Левофлоксабол



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Левофлоксацин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробное средство широкого спектра действия, фторхинолон. Действует бактерицидно. Блокирует ДНК-гиразу (топоизомеразу II) и топоизомеразу IV, нарушает суперспирализацию и сшивку разрывов ДНК, ингибирует синтез ДНК, вызывает глубокие морфологические изменения в цитоплазме, клеточной стенке и мембранах.

Активен в отношении Enterococcus faecalis, Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis, Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes и Streptococcus agalactiae, Viridans group streptococci, Enterobacter cloacae, Enterobacter aerogenes, Enterobacter agglomerans, Enterobacter sakazakii, Escherichia coli, Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Klebsiella pneumoniae, Klebsiella oxytoca, Legionella pneumoniae, Moraxella catarrhalis, Proteus mirabilis, Pseudomonas aeruginosa, Pseudomonas fluorescens, Chlamydia pneumoniae, Mycoplasma pneumoniae, Acinetobacter anitratus, Acinetobacter baumannii, Acinetobacter calcoaceticus, Bordetella pertussis, Citrobacter diversus, Citrobacter freundii, Morganella morganii, Proteus vulgaris, Providencia rettgeri, Providcncia stuartii, Serratia marcescens, Clostridium perfringens.

Фармакокинетика

При приеме внутрь абсорбируется из ЖКТ быстро и практически полностью. Прием пищи мало влияет на скорость и полноту абсорбции. Биодоступность составляет 99%. C_{max} достигается через 1-2 ч и при приеме 250 мг и 500 мг составляет 2.8 и 5.2 мкг/мл соответственно. Связывание с белками плазмы - 30-40%. Хорошо проникает в органы и ткани: легкие, слизистую оболочку бронхов, мокроту, органы мочеполовой системы, полиморфноядерные лейкоциты, альвеолярные макрофаги. В печени небольшая часть окисляется и/или дезацетилируется. Почечный клиренс составляет 70% общего клиренса.

$T_{1/2}$ - 6-8 ч. Выводится из организма преимущественно почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции. Менее 5% левофлоксацина экскретируется в виде метаболитов. В неизмененном виде с мочой в течение 24 ч выводится 70% и за 48 ч - 87%; в кале за 72 ч обнаруживается 4% принятой внутрь дозы. После в/в инфузии 500 мг в течение 60 мин C_{max} - 6.2 мкг/мл. При в/в однократном и многократном введении кажущийся V_d после введения той же дозы составляет 89-112 л, C_{max} - 6.2 мкг/мл, $T_{1/2}$ - 6.4 ч.

Показания к применению:

Инфекции нижних отделов дыхательных путей (хронический бронхит, пневмония), ЛОР-органов (синусит, средний отит), мочевыводящих путей и почек (в т.ч. острый пиелонефрит), половых органов (в т.ч. урогенитальный

хламидиоз), кожи и мягких тканей (нагноившиеся атеромы, абсцесс, фурункулы).

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Бронхит
- Отит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Синусит
- Фурункул

Противопоказания:

Гиперчувствительность, эпилепсия, поражение сухожилий при ранее проводившемся лечении хинолонами, беременность, лактация, детский и подростковый возраст до 18 лет.

Способ применения и дозы:

Применяют внутрь или в/в.

При синусите - внутрь, по 500 мг 1 раз/сут; при обострении хронического бронхита - по 250-500 мг 1 раз/сут. При пневмонии - внутрь, по 250-500 мг 1-2 раза/сут (500-1000 мг/сут); в/в - по 500 мг 1-2 раза/сут. При инфекциях мочевыводящих путей - внутрь, 250 мг 1 раз/сут или в/в в той же дозе. При инфекциях кожи и мягких тканей - по 250-500 мг внутрь 1-2 раза/сут или в/в, по 500 мг 2 раза/сут. После в/в введения через несколько дней возможен переход на прием внутрь в той же дозе.

При заболеваниях почек дозу снижают в соответствии со степенью нарушения функции: при КК=20-50 мл/мин - по 125-250 мг 1-2 раза/сут, при КК=10-19 мл/мин - 125 мг 1 раз в 12-48 ч, при КК<10 мл/мин - 125 мг через 24 или 48 ч. Длительность лечения - 7-10 (до 14) дней.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, анорексия, абдоминальные боли, псевдомембранозный энтероколит, повышение активности "печеночных" трансаминаз, гипербилирубинемия, гепатит, дисбактериоз.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, сосудистый коллапс, тахикардия.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия (повышение аппетита, потливость, дрожь).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, слабость, сонливость, бессонница, парестезии, тревожность, страх, галлюцинации, спутанность сознания, депрессия, двигательные расстройства, судороги.

Со стороны органов чувств: нарушения зрения, слуха, обоняния, вкусовой и тактильной чувствительности.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия, разрыв сухожилий, мышечная слабость, тендинит.

Со стороны мочевыделительной системы: гиперкреатининемия, интерстициальный нефрит.

Со стороны системы кроветворения: эозинофилия, гемолитическая анемия, лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, панцитопения, геморрагии.

Дерматологические реакции: фотосенсибилизация, зуд, отек кожи и слизистых оболочек, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Аллергические реакции: крапивница, бронхоспазм, удушье, анафилактический шок, аллергический пневмонит, васкулит.

Прочие: обострение порфирии, рабдомиолиз, стойкая лихорадка, развитие суперинфекции.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Левофлоксацин противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Левофлоксацин увеличивает $T_{1/2}$ циклоспорина.

Эффект левофлоксацина снижают препараты, угнетающие моторику кишечника, сукральфат, магний- и алюминийсодержащие антацидные средства и соли железа (необходим перерыв между приемом не менее 2 ч).

При одновременном применении НПВС, теофиллин повышают судорожную готовность, ГКС - повышают риск разрыва сухожилий.

Циметидин и лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, замедляют выведение левофлоксацина.

Раствор левофлоксацина для в/в введения совместим с 0.9% раствором натрия хлорида, 5% раствором декстрозы, 2.5% раствором Рингера с декстрозой, комбинированными растворами для парентерального питания (аминокислоты, углеводы, электролиты).

Раствор левофлоксацина для в/в введения нельзя смешивать с гепарином и растворами, имеющими щелочную реакцию.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют левофлоксацин пациентам пожилого возраста (высокая вероятность наличия сопутствующего снижения функции почек).

После нормализации температуры рекомендуется продолжать лечение не менее 48-78 ч. Длительность в/в вливания 500 мг (100 мл инфузиоиного раствора) должна составлять не менее 60 мин. Во время лечения необходимо избегать солнечного и искусственного УФ облучения во избежание повреждения кожных покровов (фотосенсибилизация). При появлении признаков тендинита левофлоксацин немедленно отменяют. Следует иметь в виду, что у больных с поражением головного мозга в анамнезе (инсульт, тяжелая травма) возможно развитие судорог, при недостаточности глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы - риск развития гемолиза.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью назначают левофлоксацин пациентам пожилого возраста (высокая вероятность наличия сопутствующего снижения функции почек).

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Источник: http://drugs.thead.ru/Levofloksabol